# Rec'd PCT/PTO 21 JAN 2005



特許協力条約

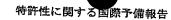
10/5218U 0 RED 28 OCT 2004 WIPO PCT

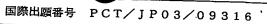
PCT

特許性に関する国際予備報告(特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条) [PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 09570	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。
国際出願番号 PCT/JP03/09316	国際出願日 (日.月.年) 23.07.2003 優先日 (日.月.年) 23.07.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl. COTE	213/64, 213/69
出願人(氏名又は名称) 株式会社クラレ	
2. この国際予備審査報告は、この表紙を	含めて全部で 3 ページからなる。
3. この報告には次の附属物件も添付され a	ている。 ^ページである。
補正されて、この報告の基礎 囲及び/又は図面の用紙 (P	とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範 C T 規則70.16及び実施細則第607号参照)
第 I 欄 4. 及び補充欄に示し 国際予備審査機関が認定した	とように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの 差替え用紙
b 置子媒体は全部で	
配列表に関する補充欄に示すよ	のに、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテー
ブルを含む。(実施細則第80	: 号答照)
4. この国際予備審査報告は、次の内容を	it.
※ 第 Ⅰ 欄 国際予備審査報告	の基礎
□ 第Ⅱ欄 優先権 □ 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又	は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
	KU I
	規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付 び説明
└── 第VI欄 ある種の引用文献	,
<ul><li>□ 第¼欄 国際出願の不備</li><li>□ 第¼欄 国際出願に対する</li></ul>	<b>意見</b>
<b>国際文件第本の時上のサ</b>	
国際予備審査の請求書を受理した日 13.01.2004	国際予備審査報告を作成した日 01.10.2004
名称及びあて先	特許庁審査官(権限のある職員) 4 P 8 2 1 3
日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915	
東京都千代田区霞が関三丁目4番3	渡辺 仁 号
	等年平月 00 0 T 0 t





第 I 欄 報告の基礎	
1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほ	か、国際出願の言語を基礎とした
<ul><li>□ この報告は、 語による翻訳文 それは、次の目的で提出された翻訳文の言語でま □ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査 □ PCT規則12.4にいう国際公開</li></ul>	を基礎とした。 pる。
PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査	
2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。 (法第 6 st た差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この	条 (PCT14条) の規定に基づく命令に応答するために提出され の報告に添付していない )
図 出願時の国際出願書類	
明細書	
☆	出願時に提出されたもの 
	一 付けで国際予備審査機関が受理したもの
請求の範囲	170 C国际 17個番重機関が受理したもの
図面         第       ページ/図、	付けで国際予備審査機関が受理したもの 出願時に提出されたもの
第 ページ/図*、 第 ページ/図*、	
配列表又は関連するテーブル   配列表に関する補充欄を参照すること。	
3.   補正により、下記の書類が削除された。	
□ 明細書 第 □ 請求の範囲 第 	ページ 項
<ul><li>□ 図面</li><li>□ 配列表 (具体的に記載すること)</li><li>□ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載す</li></ul>	ページ/図
_ •	
T PD Ameter	添付されかつ以下に示した補正が出顧時における開示の範囲を超れなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))
□ 請求の範囲 第 □ 図面 第 □ 配列表(具体的に記載すること)	ページ 項 ページ/図
配列表に関連するテーブル(具体的に記載する。	5こと)
,	·
	·
4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入	されることがある。
<del></del>	

第V欄 新規性、進歩性又は産業 それを裏付ける文献及び	上の利用可能性 説明	性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、	
1. 見解			
新規性(N)	請求の範囲 請求の範囲		有無
進歩性(IS)	請求の範囲 請求の範囲	1 – 3	有・無
産業上の利用可能性 (IA) ・	請求の範囲 請求の範囲	- <u>-</u>	有無

### 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献 1 /WO 01/96308 A1

文献 2 / US 6169184 B1

文献 3 / Tetrahedron, Vol. 58, No. 22, 20 May 2002, p. 4429-4438

文献1は、本国際出願の明細書にも引用されている文献であって、製造方法2として、5-ハロ-2-アルコキシピリジンと複素環すず誘導体や複素環亜鉛誘導体のようなアリール化合物をパラジウム触媒を用いたカップリング反応に付し、5-アリール-2-アルコキシピリジン誘導体を製造し、さらに加水分解によりピリドン誘導体を製造する方法が記載されている。

ン誘導体を製造する方法が記載されている。 文献2-3には、2-ベンゼンスルホニルピリジンやその誘導体を、有機マグネシウム化合物や有機亜鉛化合物と反応させることによるアリールクロスカップリング反応が記載されている。また、文献3には、触媒を用いない場合には、選択的にクロスカップリング反応が進行することが記載されている。

請求の範囲1-3に記載された製造方法のように、5-(2'ピリジル)-2-ピリドン誘導体の製造方法において、2-ベンゼンスルホニルピリジン誘導体と有機マグネシウム化合物などの1族、2族と金属化合物とを反応させることによるアリールクロスカップリング反応を含む方法は、記載されていないから、請求の範囲1-3に記載された製造方法は、PCT第33条(2)に規定する新規性を有する。

しかし、遷移金属触媒を用いずにクロスカップリングを進行させる方法が文献2-3には記載されているから、文献1に記載の製造方法において、クロスカップリング工程として、文献2-3の記載に基づき、2-ベンゼンスルホニルピリジンやその誘導体を有機マグネシウム化合物と反応させる工程を採用することは、当業者が容易になし得る程度のことである。したがって、請求の範囲1-3に記載された製造方法は、PCT第33条(3)に規定する進歩性を有していない。

# Translation Rec'd PCT/PTO 21 JAN 2005







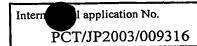
## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 09570	FOR FURTHER ACTION	See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/JP2003/009316	International filing date (day/mont 23 July 2003 (23.07.20)		
International Patent Classification (IPC) or n C07D 213/64, 213/69	ational classification and IPC		
Applicant	KURARAY CO., LTI	D.	
This report is the international preli- Authority under Article 35 and tran	minary examination report, establish smitted to the applicant according to	ned by this International Preliminary Examining  Article 36.	
This REPORT consists of a total of     This report is also accompanied by		his cover sheet.	
<u>-</u>	d to the International Bureau) a tota	l of sheets, as follows:	
sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).			
sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.			
b. (sent to the Internation	onal Bureau only) a total of (i , containing a sequenticated in the Supplemental Box	ndicate type and number of electronic carrier(s)) uence listing and/or tables related thereto, in computer Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the	
This report contains indications rel			
Box No. I Basis of the	report		
Box No. II Priority		ally investigates and industrial applicability	
Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability  Box No. IV Lack of unity of invention			
Box No. V  Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement			
Box No. VI Certain documents cited			
Box No. VII Certain defects in the international application			
Box No. VIII Certain obse	rvations on the international applica	ution	
Date of submission of the demand	Date of c	completion of this report	
13 January 2004 (13.0	01.2004)	01 October 2004 (01.10.2004)	
Name and mailing address of the IPEA/JF	Authoriz	ed officer	
Facsimile No.	Telepho	ne No.	





Box No. 1	[ Ba	asis of the report
1. With re	egard to	the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless cated under this item.
	This re	port is based on translations from the original language into the following language, is language of a translation furnished for the purpose of:
	in	nternational search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
	D pi	ublication of the international application (under Rule 12.4)
	in	nternational preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)
furnisi and ar	hed to ti re not ai	to the elements of the international application, this report is based on (replacement sheets which have been he receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" nnexed to this report):
$\boxtimes$	The inte	ernational application as originally filed/furnished
	the desc	cription:
	pages	, as originally filed/furnished
	pages*	
	pages*	received by this Additionty on
	the clai	
	pages	, as originally filed/furnished
	pages*	
ŀ	pages*	
	pages*	received by this Authority on
	the dra	
	pages	, as originally filed/furnished
	pages*	
İ	pages*	
	a seque	ence listing and/or any related table(s) - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.
1		
3.	The an	nendments have resulted in the cancellation of:
	$\Box$	the description, pages
ŀ	=	the claims, Nos.
ļ		the drawings, sheets/figs
	=	the sequence listing (specify):
		any table(s) related to sequence listing (specify):
1		any table(s) related to sequence fishing (spectyy).
4.	made, (Rule	report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box 70.2(c)).  the description, pages the claims, Nos the drawings, sheets/figs
1	Ħ	the sequence listing (specify):
	Ħ	any table(s) related to sequence listing (specify):
1		
* If ite	em 4 apj	plies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

#### REPORT ON PATENTABILITY

International application No. CT/JP03/09316

	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement				
1. Statement					
Novelty (N)	Claims	1-3	YES		
	Claims		NO		
Inventive step (IS)	Claims		YES		
	Claims	1-3	NO		
Industrial applicability (IA)	Claims	1-3	YES		
	Claims	-	NO		

2. Citations and explanations (Rule 70.7)

Document 1: WO, 01-96308, A1 Document 2: US, 6169184, B1

Document 3: Tetrahedron, 20 May, 2002 (20.05.02), Vol. 58, No. 22, pages 4429-4438

Document 1 is a document also cited in the specification of the present international application, and describes, as production process 2, a process for producing a pyridone derivative, comprising the steps of (1) subjecting a 5-halo-2-alkoxypyridine and an aryl compound such as a heterocyclic tin derivative or heterocyclic zinc derivative to a coupling reaction using a palladium catalyst, to produce a 5-aryl-2-alkoxypyridine derivative, and (2) further hydrolyzing it.

Documents 2 and 3 respectively describe an aryl cross-coupling reaction in which 2-benzenesulfonylpyridine or any of its derivatives is made to react with an organic magnesium compound or organic zinc compound. Furthermore, document 3 describes that if no catalyst is used, a cross-coupling reaction takes place selectively.

None of the above-mentioned documents describes a process for producing a 5-(2'-pyridyl)-2-pyridone derivative, including an aryl cross-coupling reaction in which a 2-benzenesulfonylpyridine derivative and a group 1 or group 2 metal compound such as an organic magnesium compound react with each other, though the production method described in claims 1-3 includes the reaction. So, the production process described in claims 1-3 appears to be novel, since it conforms to PCT Article 33 (2).

However, since documents 2 and 3 respectively describe a process for causing cross-coupling without using a transition metal catalyst, a person skilled in the art could have easily employed the process for letting 2-benzenesulfonylpyridine or any of its derivatives react with an organic magnesium compound based on the description of document 2 or 3 as a cross-coupling step in the production process described in document 1. Therefore, the production process described in claims 1-3 does not appear to involve an inventive step, since it does not conform to PCT Article 33 (3).